

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

Rec'd PCT/PTO

22 DEC 2004

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
8 janvier 2004 (08.01.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/002984 A2

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
C07D 401/12, 401/06, A61K 51/04

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2003/002028

(22) Date de dépôt international : 30 juin 2003 (30.06.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02/08203 1 juillet 2002 (01.07.2002) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : COM-
MISSARIAT A L'ÉNERGIE ATOMIQUE [FR/FR];
31/33, rue de la Fédération, F-75752 PARIS 15ème (FR).

(72) Inventeur; et

(75) Inventeur/Déposant (pour US seulement) : DOLLE,
Frédéric [FR/FR]; 10, allée de Villeneuve, F-91940
GOMETZ-LE-CHATEL (FR).

(74) Mandataire : AUDIER, Philippe; c/o BREVATOME, 3,
rue du Docteur Lancereaux, F-75008 PARIS (FR).

(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ,
BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ,
DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,
MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD,
SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,
US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (GH, GM, KE,
LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet
eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK,
TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

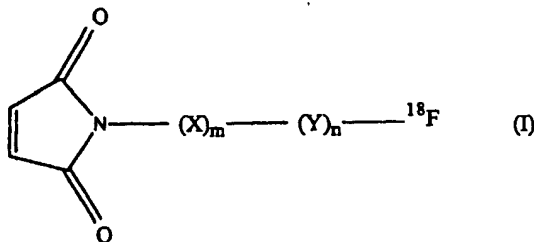
Publiée :

- avec rapport de recherche internationale
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des
revendications, sera republiée si des modifications sont re-
çues

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: MARKED MALEIMIDE COMPOUNDS, METHOD FOR PREPARING SAME AND USE THEREOF FOR MARK-
ING MACROMOLECULES

(54) Titre : COMPOSÉS DE MALEIMIDES MARQUÉS, LEUR PROCÉDE DE PREPARATION ET LEUR UTILISATION
POUR LE MARQUAGE DE MACROMOLECULES



(I)

(57) Abstract: The invention concerns maleimide compounds marked with Fluor 18 of general formula (I), wherein: m represents an integer from 0 to 10; n represents an integer from 1 to 10; Y represents a group selected among optionally substituted heterocyclic, monocyclic or bicyclic groups; X represents a radical of formula (U)_a - ((CR₁R₂)_b - (V)_c)_d - ((CR₃R₄)_e - (W)_f)_g, wherein: a, b, c, d, e, f, g represent each independently an integer from 1 to 10; 0 A 10; U, V and W represent each independently -NR₁-, -O-, -S-, formula (II), ethynyl, -CR₁=CR₂-, -(C=O)-, -(C=S)-, -C(=NR₁)-, -C(=O)O-, -C(=S)S-, -C(=NR₁)NR₂-, -CR₁R₂-, -CR₁OR₂-, -CR₁NR₂R₃-. The invention

also concerns a method for preparing said compounds, their use for marking macromolecules and complexes of said compounds with a macromolecule. The invention further concerns a kit for analysis, detection, or diagnosis using said complexes. The invention finally concerns the use of the complexes in a medical imaging method such as position emission tomography (PET).

(57) Abrégé : Composés de maléimide marqués par le fluor 18 de formule générale (I) : (FORMULE) dans laquelle : - m représente un nombre entier de 0 à 10 ; - n représente un nombre entier de 1 à 10 ; - Y représente un groupe choisi parmi les groupes hétérocycliques monocycliques ou bicycliques, éventuellement, substitués ; - X représente un radical de formule : (U)_a - ((CR₁R₂)_b - (V)_c)_d - ((CR₃R₄)_e - (W)_f)_g dans laquelle : - a, b, c, d, e, f, g représentent chacun indépendamment un nombre entier de 0 à 10 ; - U, V et W représentent chacun indépendamment -NR₁-, -O-, -S-, (FORMULE), éthynyle, -CR₁=CR₂-, -(C=O)-, -(C=S)-, -C(=NR₁)-, -C(=O)O-, -C(=S)S-, -C(=NR₁)NR₂-, -CR₁R₂-, -CR₁OR₂-, -CR₁NR₂R₃-. Procédé de préparation de ces composés ; leur utilisation pour le marquage de macromolécules et complexes de ces composés avec une macromolécule. Trousse d'analyse et de détection, ou de diagnostic comprenant lesdits complexes. Utilisation des complexes dans un procédé d'imagerie médicale tel que la tomographie par émission de positons (TEP).